

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

S2 1 PN=JP 63502885  
?t s2/5/1

2/5/1

DIALOG(R)File 351:Derwent WPI  
(c) 2002 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

007294552

WPI Acc No: 1987-291559/198741

XRAM Acc No: C87-123812

XRPX Acc No: N87-218421

**Self-admin. nose or lung spray - includes electronic timer restricting dosages to predetermined number per session**

Patent Assignee: NILSSON S E L (NILS-I); NILSSON S (NILS-I)

Inventor: FERNOE O B; LILJA J E; FERNO O; LILJA J; NILSSON S; FERNO O B

Number of Countries: 008 Number of Patents: 012

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
WO 8705813	A	19871008	WO 87SE146	A	19870320	198741 B
AU 8772003	A	19871020				198803
NO 8704873	A	19880215				198812
DK 8706098	A	19871120				198834
JP 63502885	W	19881027	JP 87502035	A	19870320	198849
FI 8804384	A	19880923				198927
US 4934358	A	19900619	US 88250691	A	19881118	199027
EP 410962	A	19910206	EP 87902175	A	19870320	199106
EP 410962	B1	19931027	EP 87902175	A	19870320	199343
			WO 87SE146	A	19870320	
DE 3787977	G	19931202	DE 3787977	A	19870320	199349
			EP 87902175	A	19870320	
			WO 87SE146	A	19870320	
FI 92469	B	19940815	WO 87SE146	A	19870320	199433
			FI 884384	A	19880923	
KR 9411286	B1	19941205	WO 87SE146	A	19870320	199642
			KR 87701081	A	19871123	

Priority Applications (No Type Date): SE 861351 A 19860324

Cited Patents: US 4462398

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
WO 8705813	A	E	16		
EP 410962	B1	E	9	A61M-016/20	Based on patent WO 8705813
DE 3787977	G			A61M-016/20	Based on patent EP 410962
					Based on patent WO 8705813
FI 92469	B			A61M-016/20	Previous Publ. patent FI 8804384
KR 9411286	B1			A61M-011/00	

Abstract (Basic): WO 8705813 A

The spray dispenser is of aerosol type, and has a manually controlled valve which when first operated brings into position an electronic control system for automatically restricting dosages to a predetermined number following the first valve operation, specifically by a locking member.

Renewed valve opening is impossible before elapse of a time period determined by the control system. Pref. the locking member is actuated magnetically. Specifically the dispenser contains nicotine or a salt of nicotine.

USE - Esp. anti-smoking therapy.

0/3

Title Terms: SELF; ADMINISTER; NOSE; LUNG; SPRAY; ELECTRONIC; TIME; RESTRICT; DOSE; PREDETERMINED; NUMBER; PER; SESSION

Derwent Class: B03; B07; P34; S05

International Patent Class (Main): A61M-016/20

International Patent Class (Additional): A61M-011/00

File Segment: CPI; EPI; EngPI

⑨ Int. Cl.<sup>4</sup>  
A 61 M 11/06

識別記号

庁内整理番号  
6737-4C

審査請求 未請求  
予備審査請求 未請求

⑨ 公表 昭和63年(1988)10月27日

部門(区分) 1(2)

(全 6 頁)

⑨ 発明の名称 過剰投与を防止して生理学的に活性の物質を自動投与する装置

⑨ 特 願 昭62-502035

⑨ 出 願 昭62(1987)3月20日

⑨ 翻訳文提出日 昭62(1987)11月24日

⑨ 国際出願 PCT/SE87/00146

⑨ 国際公開番号 WO87/05813

⑨ 国際公開日 昭62(1987)10月8日

優先権主張 ⑩ 1986年3月24日 ⑩ スウェーデン(SE) ⑩ 8601351-3

⑨ 発 明 者 ニルソン、スヴェン・エリック スウェーデン国エス-253 67ヘルシングボリイ、ドヨベリウスヴェイエン39

⑨ 出 願 人 ニルソン、スヴェン・エリック スウェーデン国エス-253 67 ヘルシングボリイ、ドヨベリウスヴェイエン 39

⑨ 代 理 人 弁理士 高木 千嘉 外2名

⑨ 指 定 国 AT, AT(広域特許), AU, BB, BE(広域特許), BG, BJ(広域特許), BR, CF(広域特許), CG(広域特許), CH, CH(広域特許), CM(広域特許), DE, DE(広域特許), DK, FI, FR(広域特許), GA(広域特許), GB, GB(広域特許), HU, IT(広域特許), JP, KP, KR, LK, LU, LU(広域特許), MC, MG, ML(広域特許), MR(広域特許), MW, NL, NL(広域特許), NO, RO, SD, SE, SE(広域特許), SN(広域特許), SU, TD(広域特許), TG(広域特許), US

最終頁に続く

請 求 の 範 囲

1. 少なくとも一つの物質と前記物質を容器外に噴射するように適応した噴射剤、好ましくは噴射ガスを収納する容器(10)と、前記物質を吐出するために前記容器に接続されたノズル(12)と、前記ノズルと前記容器との間に接続された弁(11)とを備えた過剰投与を防止して生理学的に活性の物質を自動投与するために好ましくは鼻または舌にスプレーする形式の装置において、前記弁に接続されかつ手動作動するときに前記弁(11)を所定期間中開きかつ所定の時間間隔内で所定回数投与を行なった後に前記弁(11)を同様な所定期間中再び開くことを阻止するようになつた電子制御部材(13)を備えたことを特徴とする装置。
2. 請求の範囲第1項に記載の装置において、弁(11)が開いているときに容器(10)が弁(11)と直接に接触しかつ弁(11)の開放時間を設定することにより所定の投与量を制御可能であることを特徴とする装置。
3. 少なくとも一つの物質と前記物質を容器外に噴射するように適応した噴射剤、好ましくは噴射ガスを収納する少なくとも1個の容器(10)と、容器(10)の吐出口(18)と、作動部材を有する弁とを備え、前記作動部材は各々の移動時に前記弁を作動して前記吐出口(18)を通して所定投与量の前記物質を供給するために前記容器(10)に対して手動により移動可能である過剰投与を防止して生理学的に活性の物質を自動投与する

ために好ましくは鼻または舌にスプレーする形式の装置において、前記容器(10)に接続されかつ前記作動部材の所定回数の移動およびそれに相当する回数の投与後に機械的なロック(22)を前記作動部材または前記容器(10)と交互にロック係合するように作動させて所定の期間中の前記作動部材と前記容器との間の相対移動を阻止するようになつた電子制御部材(13)を備えたことを特徴とする装置。

4. 請求の範囲第2項に記載の装置であつて、前記容器(10)が移動可能に装填されたパイプの形態でありかつ弁作動部材を構成する容器吐出口(18)と連絡するノズル(12)を有するケーシング(20)内に移動可能に装填され、前記容器の一方の端部が前記ケーシング(20)から突出しかつ投与量を供給するために前記ケーシング(20)内のストッパと係合する前記吐出口ノズル作動部材を移動するために前記ケーシング(20)内に手動で挿入可能である装置において、前記ロック(22)が引込み位置と前記容器内の凹部と係合する位置との間に位置により移動可能であることを特徴とする装置。

5. 請求の範囲第1項から第4項までのいずれか1項に記載の装置において、生理学的に活性の物質がニコチンまたはその塩類であることを特徴とする装置。

## 明 細 書

過剰投与を防止して生理学的に活性の物質を自動投与する装置

本発明は、少なくとも一つの物質と前記物質を容器外に噴射するように適応した噴射剤、好ましくは噴射ガスとを収納する容器と、前記物質を吐出するために前記容器に接続されたノズルと、前記ノズルと前記容器との間に接続された弁とを備えた過剰投与を防止して生理学的に活性の物質を自動投与するために好ましくは鼻または口にスプレーする型式の装置に関する。

生理学的に活性の物質、例えば、薬品を単位時間あたり所定の量で自動投与してそれにより危険な過剰投与を阻止可能であることが所望される多数の用途がある。例えば、催眠剤を投与する場合に、もしも投与量が投与された後に、次の投与量の投与前に一時間または二時間待たなければならぬとすれば、その投与は有利であろう。過剰投与を防止する一つの方法は、生理学的に活性の物質をある機械的な作用形態で徐々に放出するマトリックスで該物質を適用することである。この一つの例は、ニコチンを含有する最初の喫煙抑制薬品である良く知られたニコチンチユウイングガムである。ニコチンは、口腔内に吸収される。また、ニコチンは、チユウイングガムにより放出されるにつれて比較的徐々に吸収される。タバコの喫煙者は、ニコチンを極めて迅速に吸収する。血中のニコチンの濃度は、4時のニコチンチユウイングガム

をかんでから20〜30分後のニコチンの濃度よりも高い値に既に達している。このニコチン吸収率の差異にもかかわらず、喫煙を止めようとする人々は、通常、このようなチユウイングガムの助けにより禁煙を達成することができる。しかしながら、すべての喫煙者がニコチンチユウイングガムを使用できるわけではなく、機会的なまたは社会的な局面からガムをかむことができないことがある。なかんずく、胃腸系内で二次的な作用が起こることもある。

ニコチンをより迅速に吸収し、胃腸内の二次作用を防止しかつチユウイングガムをかむことが困難な人の喫煙解毒処置を行う場合のニコチン治療を容易にする目的のために、鼻内にニコチンを含有するビスコース溶液を投与することが試みられた。これらの試みを行った結果、ニコチンがより迅速に吸収された。それ故に、鼻を通じてのニコチンの吸収は、喫煙解毒処置の別の可能性であると思われる。これについては、勿論、ニコチンが鼻にスプレーするかわりに投与されることは、明らかであろう。鼻にスプレーする方法を使用することにより、はるかに大きい領域にわたってニコチンをさらに均一に分布することができ、それによりより迅速かつ安全なニコチンの吸収を達成することができる。さらに一つの利点は、鼻内へのスプレーがビスコースニコチン溶液よりもはるかに容易に適用可能であることである。しかしながら、鼻内へのスプレーはよりひんばんな時間間隔で反復投与す

ることがはるかに容易であることと、ニコチン投与とニコチン吸収との間の時間間隔と相俟つて、これが病気の発作や目まいを容易に引き起こして例えば自動車の中枢機構を大幅に損傷することがありうるので、喫煙解毒処置を行う場合に、ニコチンを含むビスコース溶液を鼻にスプレーする方法の採用に対する大きい障害になる。また、この理由から、鼻へのスプレーは、好適でないとして認定された。

本発明は、過剰投与を防止して鼻および口にスプレーすることを目的とするものである。

鼻または口にスプレーするエアゾールパックは、その最も簡単な形態において、開放可能な弁を有するガス容器を備えている。このガス容器は、噴射ガスと、投与されるべき化学物質とを收容する。噴射ガスは、無害な不活性ガスまたは例えば圧縮空気とすべきである。このガス容器内の化学物質は、固体または液体であり、かつ溶液、エマルジョンまたは懸濁液とすることができる。このガス容器内には、過剰の圧力が作用している。ガス容器の弁が開かれたときに、噴射ガスは過剰の圧力により膨張せしめられ、そして生理学的に活性の物質を伴って狭い出口を通過し、出口にエアゾールが形成される。エアゾールの噴射ガスは、液体または固体の粒子を吸収面に運ぶ。液体または固体の粒子は、吸収面に付着する。その後、これらの生理学的に活性の物質は、吸収面の細胞膜を通じて吸収され、人体組織に作用する。エアゾー

ルパックの出口または延長管は、吸収面または内部に前記物質を投与する腔部に向けられる。

本発明の目的は、序文に述べた装置において、弁に接続されかつ手操作により作動させたときに前記弁を所定期間中開きかつ所定期間内内で所定期間投与を行なつた後に前記弁を同様の所定期間中再び開くことを阻止するようになつた電子制御部材により達成される。

本発明においては、エアゾールパックのガス容器の弁の開閉は、多数のトランジスタ機能をも有するプログラム可能な電子チップを介して電氣的に制御される。本発明による簡単な実施例においては、エアゾールパックは、電池および電子開閉接点により補助される。

慣用のスプレー投与は、正確な投与を行なうために、投与量噴射ガス容器が手動で開放したときにノズル開口部と直接に接触せずそれにより機械的な装置により分離された所定の投与量のみが投与される既知の技術を使用している。このスプレー型式の装置は、本発明による電子的に制御される弁により機械的に分離された投与量とノズル開口部との間に設けることができる。この場合には、手動により開放されかつ電子的に制御される開弁時間は、機械的に予め決定された投与量を放出可能にするために十分に長く設定しなければならない。

別の型式のスプレーパックにおいては、投与量噴射ガス容器は、手動で開放したときに、電子的に制御されて開く弁と直接に接触する。この場合には、投与量は開弁

時間により決定される。正確な投与は、ガス容 内のガス量が所定回数の噴射ガスの放出により単位時間あたりの生理学的に活性の物質の放出量に影響を与えない程度であるという状態の下で実施可能である。弁が開かれて使用者に生理学的に活性の物質を正確に所定の投与量だけ供給する時間は、活性物質の型式、ガス容 内の圧力状態および弁の機能に関する細部に機械的な構造上の問題により左右される。特定の時間パラメータは、本発明の各々の運用時に決定しかつ電子制御装置にプログラムすべきである。

電子プログラミングの寛容度により、開弁制御スケジュールを多数の異なる方法で変更することが可能である。もしも電子制御装置が簡単なマイクログロブセンサであれば、アルゴリズムに翻訳することができる任意の制御スケジュールを使用することができる。

本発明は、制御スケジュールが上限を単位時間あたりの投与回数に因して設定しておりかつ電子的な構造により使用者が制御スケジュールにアクセス不可能であるという理由で高度に活性の物質を自動投与可能である点で特に有利である。

今日最も一般的に使用されているスプレーパックは、一方の端部に吐出管を設けた容器を備えている。この吐出管は、前記一方の端部に押し込むことができる。吐出管が容器内に押し込まれたときに、容器の中味のうちの所定の投与量が放出される。前述した事項により、この

ようなスプレーパックには、前述した原理で制御される弁を設けることができるが、本発明は、容器と吐出管との間の相対運動を利用することにより、付加的な弁を設けずに適用することも可能である。したがって、容器に接続されかつ弁作動部材の所定回数の移動およびそれに相当する回数の投与量の供給後に機械的なロックを弁作動部材または容器と交互にロック係合するように作動させて所定の期間中の前記弁作動部材と前記容器との間の相対移動を阻止するようになつた電子制御部材を使用することができる。

本発明を一実施例を略図で例示した部付図面について以下にさらに詳細に説明する。

第1図は慣用の設計の弁を備えたエアゾール装置を示した図。

第2図は別の設計の容器を有する装置を示しかつ機械構造を例示した図。

第3図は容器の時間回路の設計を例示した図である。

第1図は、市販されている型式のガス缶を示している。このガス缶は、一方の端部に吐出管(18)を備えた閉ざされた円筒形の容器を備えている。吐出管(18)は、容器の一方の端部内に所定の距離押し込みそれにより噴射ガスの作用により容器(10)内の物質を所定の投与量供給することができる。したがって、吐出管(18)は、また、弁作動部材として作用する。容器(10)は、下向きに開口したケーシング(20)内に収納されている。ケーシング(20)

は、吐出管(18)から離れる方向に向いた容器(10)の端部がケーシング(20)から突出する寸法に形成されている。容器(10)を収納するようになつたケーシング(20)のスペースのまわりには、以下にさらに詳細に記載する電子制御部材(15)を収納する上側環状部材ならびに電池(15)を収納する下側環状部材が配置されている。容器(10)は、これらの環状部材によつて形成されたスペース内に好適に固定されて移動可能に配置されている。ケーシング(20)は、その上側端部に容器(10)の吐出管(18)の上側環状部材を締めにより収納する穴を有しておりそれにより容器(10)はケーシング(20)内に保持され、しかも同時に容器(10)と吐出管(18)との間の相対移動により移動可能である。吐出管(18)を収納する穴は、ノズル(12)と連絡している。したがって、容器(10)は、第1図に示した位置からケーシング(20)内に押し込むことができそれにより固定吐出管(18)が容器(10)内に押し込まれ、その結果、前記吐出管(18)からノズル(12)に投与量が供給される。

投与量を供給するための容器(10)と吐出管(18)との間の各々の相対移動中、電子制御部材(15)がこの相対移動を電気的にまたは機械的に検出し、そして通常、1回または2回である所定回数の投与量が供給されたときに、電子部材(15)が磁石またはソレノイド(21)を動作させてロックを形成するアンカー(22)を押圧して容器(10)の環状部材と係合させる。この作動状態は、所定の期間

中、維持される。その間、容器(10)と吐出管(18)との間には、それ以上の相対移動は起こらず、すなわち、容器(10)は押し込み位置に保持され、したがって、投与量は供給されない。回路(15)を動作する動力は、下側環状部材内の電池(15)により供給される。

また、本発明は、容器に対して移動せしめられる弁作動部材を手動で動作させることにより投与量が供給されかつアンカー(22)が容器または弁作動部材と係合して弁作動部材と容器との間の相対移動を阻止してそれにより投与量の供給を阻止するその他の型式のスプレーパックにも適用することができる。

上記の実施例は、最も簡単な例であるが、本発明の値からさらに精巧な実施例を第2図および第3図について以下説明する。

本発明によるエアゾール装置は、異なる物質を収納した1個またはそれ以上のガス容器(10)を備えることができる。これは、異なる物質の組合わせをも投与することができることを意味している。第2図は、異なる別々の化学物質を収納するガス容器(10)、(10')、(10'')の包括的な装置の設計を示している。共通のノズルを形成する吐出管(12)には、別々のガス容器(10)、(10')、(10'')からの別々の物質が各々の容器の開口した弁(11)、(11')および(11'')からそれぞれ供給される。スイッチ(17)により動作させることができかつ制御チップ(15)の型式である電子制御部材がすべての動作を制御するようになつている。

高度の用途においては、制御チップ(13)に、例えば、LCD 型式の表示窓(14)が接続されている。表示窓(14)は、もしもエアゾールがロックされれば、最大の投与量に達して異なる状態、例えば、電池(15)の低い電圧が作用するので、所定の投与回数に関する情報を供給する。第1図に示したより簡単な実施例もまたこのように表示窓(14)を備えることができる。エアゾール缶には、種々の型式のパラメータ、例えば、単位時間あたりの投与の頻度、弁開放時間、すなわち、投与量を供給してそれにより例えば別々の患者に同一のエアゾール缶構造により別々の投与処方を与えるためのパネル(16)を設けることができる。パラメータ供給用パネル(16)は、一つのプログラミングを行なうことができそれにより使用者自身が設定を変更することを阻止するように設計することができる。制御チップ(13)としては、マイクロコンピュータチップまたは顧客の注文により設計された構造を使用することができる。弁(11)、(11')、(11'')としては、電流消費が少ないソレノイド型式の弁またはシリコンを備えた機械的な弁を使用することができる。弁(11)、(11')、(11'')は、機械的な構造の可動部分を構成する小型の電動機を備えることができる。第2図は、本発明によるエアゾール缶にガス容器(10)を設けることができる態様を例示している。この実施例は、この特定の用途のためにプログラムされるマイクロコンピュータチップ(13)を使用している。このエアゾール缶を魅力的に設計するために、マ

イクロコンピュータチップ(13)および弁(11)は、一体に構成され、かつ電池(15)および情報システム(14)は、容易に接近可能にするために、エアゾール缶の外周に装着される。

#### 通 用 例

ニコチンは、前述したように、本発明を適用することができる医薬的に活性な物質の一例である。ニコチンは、有毒以下の(SUBTOXIC)投与量においても不快な二次作用、例えば、めまいや吐き気等の不快感を生ずる。本発明によるニコチンを含有する鼻内へのスプレーは、前述したように、スプレーを容易に適用可能でありかつニコチンをより迅速に作用させる点で有利であろう。過剰投与は、本発明による正しいプログラミングにより阻止される。ニコチン溶液用のエアゾールパックは、延長したノズルまたはパイプを備えるように設計されているので、その中実を鼻内に本質的に保持される粒粒の微細な液滴または微粒の形態で供給することができる。弁を押し下げる頻度、2秒のニコチンの投与量を与えるようにタイミングスケジュールを設計することができる。30分あたりの最大の投与量は、例えば、2秒または4秒に設定される。最初の場合には、新しい投与量が30分後のみに供給される。第二の場合には、もしも二回の投与の間に30分を経過していなければ、別の30分後のみに新しい投与量が投与されるように、タイミングスケジュールが完了する。これらのタイミングスケジュールは、マイク

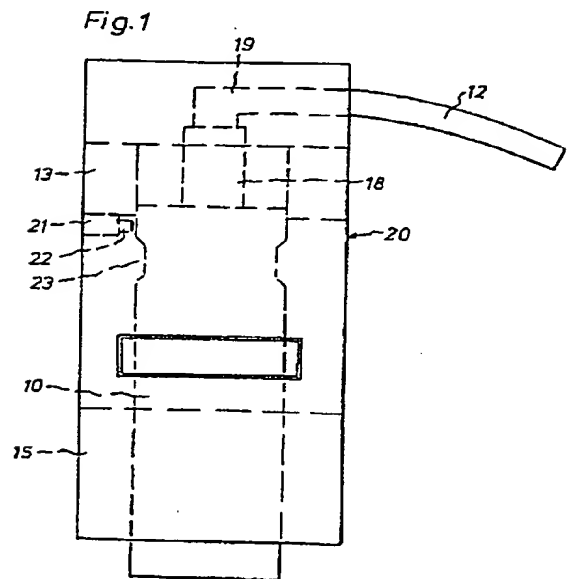
コンピュータチップまたは顧客の注文により設計されたチップに設定されることが好ましい。

しかしながら、本発明は、ニコチンの使用に限定されるものではなく、また種々の生理学的に活性の物質に適用することができる。例えば、インシュリン、抗アレルギー性薬品、ホルモンおよびある程度を鼻内にスプレーすることにより運用することができる。抗喘息薬を投与するために、肺内へのスプレーを行なうことができる。

本発明を自動投与に不適当な経口投与薬を経口投与するためにも適用することができる。この場合には、薬はエアゾールの形態で供給されないので、液体、例えば、溶液、懸濁液またはエマルジョンの形態で供給され、かつ開弁はこの目的のために設計される。

本発明は、使用者にとっては、容易に運用することができかつ生理学的に活性の物質を迅速に吸収させることができるという点で有利である。過剰投与のリスクを實際に排除することができ、かつよく効く薬を自動投与することができる。

尚業者は、以上の説明および請求の範囲に記載の本発明の範囲内で種々の変型、変更を実施することができることは、明らかであろう。



*Fig. 2*

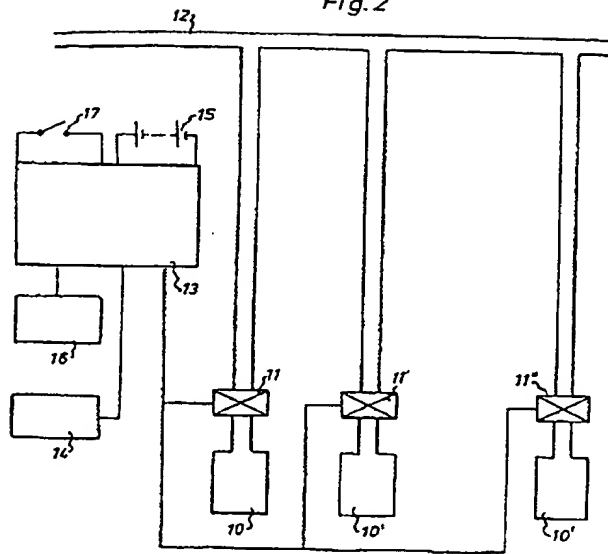
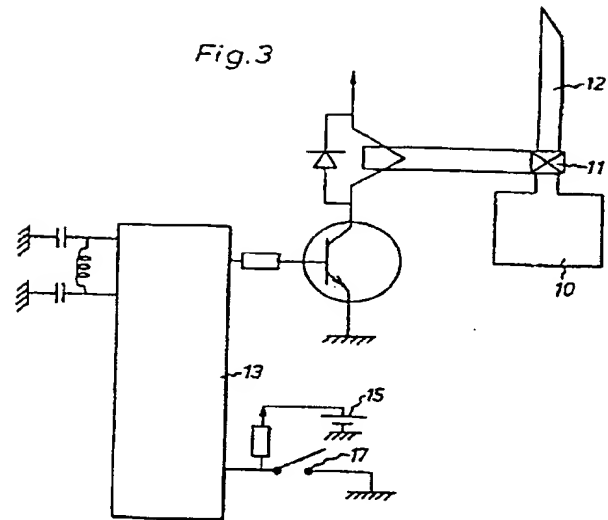


Fig.3



國際調查報告

International Application No. PCT/SE87/00145

[illegible]

第1頁の続き

⑦発明者

フェルニョー、ウーヴエ・ビル  
ゲル

スウェーデン国エス・252 20 ヘルシングホルイ。セント クレ  
メンスガータ 14

⑧発明者

リーヤ、ヤン・エーヴェルト

スウェーデン国エス・291 65 クリスツィアンスタード。フロー  
デスヴェーグ 17